

## ⑫ 公開特許公報(A)

昭63-287717

⑮ Int.Cl.<sup>4</sup>

A 61 K 9/02

識別記号

庁内整理番号

A-6742-4C

⑬ 公開 昭和63年(1988)11月24日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全2頁)

⑭ 発明の名称 水溶性基剤を使用した医療用坐剤の構成

⑯ 特 願 昭62-124571

⑰ 出 願 昭62(1987)5月20日

⑱ 発 明 者 竹 中 繁 三 郎 京都府京都市山科区音羽八の坪33番地

⑲ 出 願 人 竹 中 繁 三 郎 京都府京都市山科区音羽八の坪33番地

## 明 細 書

## 1. 発明の名称

水溶性基剤を使用した医療用坐剤の構成。

## 2. 特許請求の範囲

坐剤の基剤に水溶性基剤(日本薬局方マクロゴール)を使用して製造された坐剤本体の表面を潤滑化ならしめるため生体の体温で容易に軟化する日本薬局方カカオ脂の如きで被膜(コーティング)を施した製品を作製することを特長とした坐剤の構成。

## 3. 発明の詳細な説明

坐剤の構成は通常対象疾患の治療に必要とする薬剤を下記に提示した①または②の基剤等と均等に混合して製造される。

## ① 油脂性基剤

日本薬局方カカオ脂, ヨーロッパ薬局方ヴィテブゾール, その他。

## ② 水溶性基剤

日本薬局方マクロゴール。

坐剤の形状は肛門より直腸内に挿入し易いよう

の形状, 即ち円すい形又は紡すい形に固められており, 通例重さは1~3g, 長さ3~4cmである。

坐剤投与とその作用機序は坐剤が肛門内部に挿入された場合直腸内において薬剤は混合されている基剤と共に徐々に融解されることにより薬剤は放出されて薬効を発揮する機序であるが, 上述①に示した油脂性基剤を使用して製造された坐剤では生体の体温により基剤は自然に融解され挿入も容易で, 挿入後の薬剤の放出も自然に行われ得るところである。

然し本発明による上述②に示した水溶性基剤を使用して製造された坐剤では基剤として使用のマクロゴールの性状が体温のみにては融解せず, 直腸内の水分(分泌液)によつて融解される機序であるため本剤の肛門内挿入時において肛門局部周囲の乾燥状態下では坐剤の表面には潤滑性は無いため当然挿入摩擦痛を生じる。

この挿入摩擦痛は精神的にも患者の極めて嫌悪する副作用の一つである。

従つて水溶性坐剤の使用に當つての肛門局部の挿入摩擦痛を避けるためには予めその局部を潤滑にしておくことが肝要であり、例えば油脂類等を塗布しておくことの前処置を必要とする。

本発明はこれらの水溶性基剤を使用して製造された坐剤の使用操作上の欠陥を防備するため坐剤本体の表面を日局カカオ脂等の生体の体温で容易に軟化して坐剤の表面に潤滑性を付与せしめ、挿入を容易ならしめるために被膜(コーティング)を施した坐剤の新らしい製品の構成である。

なお、この被膜の厚さは1mm以下(図1及び2)で十分に目的は達成し得る。

本発明による坐剤の使用に際しては坐剤1個宛に直接被包された本剤1個をその被包のまま10数秒間掌中に把握することにより坐剤は生体の体温によりその被膜は軟化されて潤滑性を帯び来たる故本剤を被包より取り出して使用することにより挿入時の不快な副作用を伴うことなく、安全に挿入操作を成し得るところとなる。

近時坐剤は医療上投与法の簡便のため内服薬や注射薬投与に代り広く多用されつつあり、特に本発明の対象である水溶性坐剤は夏期の高温度下に於ても基剤マクロゴールの性状が温度には安定で薬剤の剤形等にも影響を及ぼさず、四季を通じての常温下での保管に適する特長を具備する。

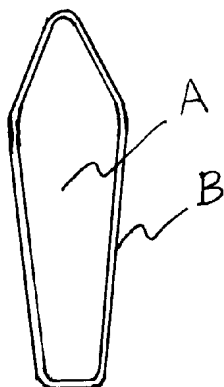
これに加え本発明に於ての坐剤の構成における便益性は一層高く評価され得るところである。

#### 4. 図面の簡単な説明

第1図は円すい形本坐剤を中央部より縦断した切面の平面図を示し、第2図は同本坐剤の中央部より横断した切面の平面図。

##### 符号の説明

Aは本坐剤の本体、Bは本坐剤の表面に施された被膜(コーティング)の状態を示す。



第1図



第2図